

①9 BUNDESREPUBLIK  
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES  
PATENTAMT

①2 **Offenlegungsschrift**  
①1 **DE 38 16 447 A 1**

⑤1 Int. Cl. 4:  
**A61 K 7/06**  
A 61 K 7/075  
// A61K 31/505

②1 Aktenzeichen: P 38 16 447.7  
②2 Anmeldetag: 13. 5. 88  
④3 Offenlegungstag: 24. 11. 88

*Behördenstempel*

DE 38 16 447 A 1

③0 Unionspriorität: ③2 ③3 ③1  
15.05.87 US 050935

⑦1 Anmelder:  
Holden, John, Port Alberni, British Columbia, CA

⑦4 Vertreter:  
Splanemann, R., Dipl.-Ing.; Reitzner, B., Dipl.-Chem.  
Dr.rer.nat.; Baronetzky, K., Dipl.-Ing.(Univ.),  
Pat.-Anwälte, 8000 München

⑦2 Erfinder:  
gleich Anmelder

⑤4 **Haarerneuerungsmittel**

Die Erfindung betrifft Haarerneuerungsmittel, die einen Wirkstoff und einen Träger enthalten. Bei dem Wirkstoff handelt es sich um Minoxidil und beim Träger um Dimethylsulfoxid. Das Mittel wird zweckmäßig als Shampoo formuliert und gebraucht.

DE 38 16 447 A 1

## Patentansprüche

1. Haarerneuerungsmittel, enthaltend etwa 5 bis 200 mg Minoxidil 6-(1-Piperidiny)-2,4-pyrimidindiamin-3-oxid auf 100 ml Lösung in Dimethylsulfoxid.
2. Haarerneuerungsmittel nach Anspruch 1, enthaltend auf 100 ml Lösung etwa 5 bis 95 ml Dimethylsulfoxid, etwa 95 bis 5 ml eines nichtionischen Tensids und etwa 5 bis 200 mg Minoxidil.
3. Haarerneuerungsmittel nach Anspruch 1, enthaltend auf 100 ml Lösung etwa 5 bis 200 mg Minoxidil, etwa 5 bis 20 ml eines nichtionischen Tensids, Rest Dimethylsulfoxid.
4. Haarerneuerungsmittel nach Anspruch 2 oder 3, dadurch gekennzeichnet, daß das Tensid einen polyoxyethylierten Sorbit-Oleatester dargestellt.
5. Verfahren zur Haarerneuerung, dadurch gekennzeichnet, daß man auf die betroffene Stelle ein Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 4 aufbringt.

## Beschreibung

Die Erfindung betrifft Haarerneuerungsmittel, insbesondere in Form von Shampoos. Andere Formulierungen, z.B. Frisierhilfsmittel (hair dressing) oder andere kosmetische Mittel sind ebenfalls möglich.

In der Vergangenheit wurden bereits viele Präparate als Haarerneuerungsmittel (Haarwuchsmittel) vorgeschlagen. Im allgemeinen enthalten diese Mittel im wesentlichen drei Bestandteile: einen Wirkstoff mit mindestens einem gewissen Effekt auf die Haarfollikel; ein Trägersystem für den Wirkstoff; sowie weitere Bestandteile für ein kundenfreundliches Verpackungssystem, wie Farbstoffe, Verdickungsmittel, Parfums, Opakmacher und dergl. Letztere umfassen auch weitere Bestandteile, die zusätzlich zum Träger für erforderlich gehalten werden, um das Aufbringen des Mittels zu erleichtern. So wird für ein Shampoo ein geeignetes Tensid verwendet. Der Träger soll, soweit möglich, gewährleisten, daß der Wirkstoff an die Haarfollikel gelangt. Viele Kosmetika enthalten keinen besonderen Träger, sondern verlassen sich zu diesem Zweck auf die restlichen Bestandteile des Mittels. In anderen Fällen ist der Träger lediglich deshalb vorhanden, um die Verträglichkeit des Wirkstoffes mit den restlichen Bestandteilen des Mittels zu gewährleisten.

Von den vielen Substanzen, denen in der Vergangenheit eine haarerneuernde Wirkung zugeschrieben wurde, ist eine der wenigen, die sich bei der Förderung der Haarfollikel-Aktivität als wirksam erwiesen haben, die Verbindung "Minoxidil" (internationaler Freiname für 6-(1-Piperidiny)-2,4-pyrimidindiamin-3-oxid). Die Herstellung dieser Verbindung ist in der US-PS 33 82 247 beschrieben. Die Verbindung ist auch als blutdrucksenkendes Mittel bekannt. Diese Verbindung hat jedoch im Zusammenhang mit der Haarerneuerung noch keine Akzeptanz gefunden, weil sie offensichtlich nicht die ihr zugeschriebenen Wirkungen hatte. Haarerneuerungsmittel auf der Basis dieser Verbindung als Wirkstoff waren offensichtlich wirkungslos oder nicht so wirksam, wie man vernünftigerweise erwarten konnte. Der Grund für dieses unbefriedigende Verhalten wurde nun gefunden: Der Wirkstoff wurde bisher in gänzlich ungeeigneten Formulierungen verwendet, die eine volle Ausnützung seines Potentials noch nicht gestatteten. Bei diesen bekannten Formulierungen handelte es sich um Haarcremes oder Tagescremes auf Ölgrundlage. Es wird angenommen, daß diese im wesentlichen öltartige

oder fettige Grundlage zwar eine ausreichende Dispergierung des Minoxidils bewirkt, aber auch den Zutritt des Minoxidils zu den Haarfollikeln wesentlich zu behindern scheint. Es wurde nun eine einfache und leicht herstellbare Minoxidilformulierung gefunden, mit deren Hilfe diese Schwierigkeiten überwunden werden und eine Maximierung des Zutritts des Minoxidils zu den Haarfollikeln erzielt werden kann. Gegenstand der Erfindung ist somit ein Haarerneuerungsmittel (Haarwuchsmittel), das im wesentlichen eine Lösung darstellt, die etwa 5 bis 200 mg Minoxidil in 100 ml Dimethylsulfoxid enthält.

Zweckmäßig wird dieses Mittel zur Verwendung als Shampoo formuliert. In dieser Form enthält das Mittel etwa 5 bis 200 mg Minoxidil, etwa 5 bis 95 ml eines flüssigen, nichtionischen Tensids und etwa 95 bis 5 ml Dimethylsulfoxid auf 100 ml Lösung. Nach einer bevorzugten Ausführungsform enthält eine derartige Shampoo-Zusammensetzung etwa 5 bis 200 mg Minoxidil, etwa 5 bis 20 ml flüssiges, nichtionisches Tensid, wobei der Rest auf 100 ml Lösung Dimethylsulfoxid darstellt. Bevorzugte Tenside sind Polyoxyethylenderivate von Sorbitestern, insbesondere von Sorbitoleat, das als "Tween 80" (Wz) bekannt ist.

Bei Gebrauch wird das Mittel einige Minuten auf die betroffenen Stellen aufgebracht und einmassiert. Nach kurzer Zeit, zum Beispiel nach 15 Minuten, kann ein Shampoo aufgebracht werden, worauf das Haar in der üblichen Weise gewaschen wird.

Dem Mittel können ferner die üblichen Zusätze, wie Farbstoffe, Verdickungsmittel, Parfums und dergl. beigegeben werden.

TC  
16

9-2903